

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representation of
The original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problem Mailbox.**

⑨ 日本国特許庁 (JP)
⑩ 公開特許公報 (A)

⑪ 特許出願公開
昭55-124763

⑫ Int. Cl.³
C 07 D 213/64
213/70

識別記号 庁内整理番号
7138-4C
7138-4C

⑬ 公開 昭和55年(1980)9月26日

発明の数 1
審査請求 未請求

(全 3 頁)

⑭ 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体

⑮ 特 願 昭54-32068
⑯ 出 願 昭54(1979)3月19日
⑰ 発 明 者 西山隆三
高槻市真上町5丁目41番22号
⑱ 発 明 者 藤川致一
守山市浮気町321番地の31
⑲ 発 明 者 横道勲
草津市野村町221番地

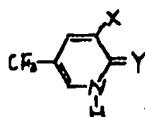
⑳ 発 明 者 芳賀隆弘
草津市野村町221番地
㉑ 発 明 者 長谷邦昭
守山市浮気町321番地の31
㉒ 発 明 者 林弘仁
守山市浮気町321番地の31
㉓ 出 願 人 石原産業株式会社
大阪市西区江戸堀1丁目3番11号

明 細 書

1. 発明の名称 5-トリフルオロメチル-2-
ピリドン誘導体

2. 特許請求の範囲

1. 一般式

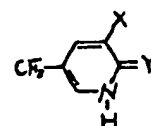


(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体。

3. 発明の詳細な説明

本発明は医薬、農薬、染料などの中間原料として有用で、新規な5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体に関する。

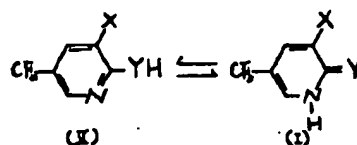
詳しくは本発明は一般式



(I)

(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体である。

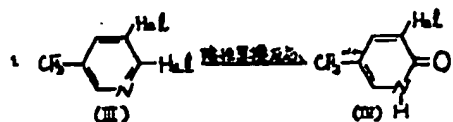
前記一般式(I)の5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体は、次に示すような互変異性として存在することができる。



(式中X及びYは前記の通りである)

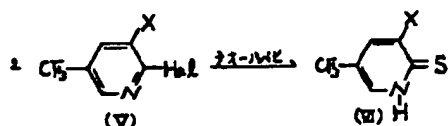
前記一般式(I)において、Xで表わされるハロゲン原子としては弗素、塩素、臭素、アスタト素がけられる。

本発明の5-トリフルオロメチル-2-ビリ
ドン誘導体は適、例えば下記方法によって製
造される。



(上記反応式中 Hs はハロゲン原子である)

一般に上記反応はジメチルスルホキシド、ジ
メチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶
媒中、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなど
のアルカリ水溶液を用いて50〜150℃、0.1
〜10時間で行なわれる。



(上記反応式中 X 及び Hs は前述の通りで
ある)

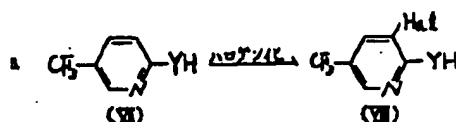
一般に上記反応はメタノール、エタノールな
どのアルコール類、ジメチルスルホキシド、ジ
メチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶

- 3 -

媒とを反応させることによりN-ベンゾイ
ル-N'-[4-(5-トリフルオロメチルビリ
ジン-2-イルオキシ)フェニル]ウレア系化
合物に誘導できる。詳しくは本発明化合物の3
-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ビリ
ドンと3,4,5-トリクロロニトロベンゼンとを
縮合、還元して3,5-ジクロロ-4-(3-ク
ロロ-5-トリフルオロメチルビリジン-2-
イルオキシ)アニリンを得、更にこのものと2
6-ジフルオロベンゾイルイソシアネートとを
反応させると、N-(2,6-ジフルオロベンゾ
イル)-N'-[3,5-ジクロロ-4-(3-ク
ロロ-5-トリフルオロメチルビリジン-2-
イルオキシ)フェニル]ウレアを得ることがで
きる。このものは殺虫剤の有効成分として優れた
活性を示し、種々の有害虫、特に有害昆虫の
防除に有効であって、例えばこの化合物¹⁰⁰ 100
ppm水溶液にキャベツの葉片を浸漬し、それ
を風乾してそこへ2〜3頭のコナガの幼虫を放
ち、8日目に生死を判定した結果、100%の

特開55-124763(2)

死など 溶液中、チオ尿素、硫化ソーダ、チオ
硫酸ソーダ、N,N-ジメチルジチオカルバミ
ン酸ソーダなどのチオール化剤を用いて50〜
還流温度0.5〜10時間で行なわれる。



(上記反応式中 Y 及び Hs は前述の通りである)

一般に上記反応は四塩化炭素、クロロホルム、
酢酸、二硫化炭素、水、非プロトン性極性溶媒
などの溶液中、塩素ガス、臭素、チオニルクロ
ライド、スルフィルクロライドなどのハロゲン
化剤を用いて0〜100℃、0.5〜10時間で行
なわれる。

本発明化合物は、例えばハロゲン化ニトロベ
ンゼン類と縮合させて4-(5-トリフルオロ
メチルビリジン-2-イルオキシ)ニトロベン
ゼン類を生成させ、これを還元して得られる4
-(5-トリフルオロメチルビリジン-2-イ
ルオキシ)アニリン類とベンゾイルイソシア

- 4 -

死虫率が得られた。

次に本発明化合物の具体的合成例を記載する。

合成例1 3-クロロ-5-トリフルオロメチ
ル-2-ビリドン

(A)

5-トリフルオロメチル-2-ビリドン0
2gをクロロホルム20mlに溶解させ、50
℃に加温して塩素ガスを1時間攪拌下に通じ
た。反応終了後、クロロホルムを留去し、ト
ルエン-n-ヘキサンの混合溶媒で再結晶し
て融点144〜147℃の目的物0.15gを
得た。

(B)

水酸化ナトリウム2.4gを水125mlに溶
解させた水溶液に2,3-ジクロロ-5-トリ
フルオロメチルビリジン4gを加え、更にジ
メチルスルホキシド12.5mlを加えて加熱し、
110℃で1時間攪拌下に反応させた。反応
終了後生成物を放冷し、炭酸酸で酸性にして
沈殿物を得、このものを濾過して目的物2.5

- 5 -

- 6 -

ヲを得た。

合成例 2 5-トリフルオロメチル-2-チオ
ピリドン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリ
ジン4gとチオ尿素1.67gとをエタノール
30mlに溶解させ、加熱して還流状態で3時
間攪拌下に反応させた。その後、水酸化カリ
ウム水溶液1.23gを徐々に加えて還流状態
で1時間反応させた。反応終了後、生成物を
放冷し、希アルカリ水溶液中に投入して塩化
メチレンで洗浄し、酢酸で酸性にした。次い
で、塩化メチレンで抽出し、抽出層を水洗後
無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、塩化メチレ
ンを留去して融点147~150℃の目的物
2.1gを得た。

合成例 3 3-ブロモ-5-トリフルオロメチ
ル-2-ピリドン

5-トリフルオロメチル-2-ピリドン0.
4gを酢酸10mlに溶解させ、そこへ臭素0.
4gを加えて攪拌下で4時間反応させた。反

- 7 -

特開55-124783(3)

反応終了後、酢酸を留去し、塩化メチレン-ロ
-ヘキサンの混合溶媒で再結晶して融点162
~165℃の目的物0.45gを得た。

合成例 4 3-クロロ-5-トリフルオロメチ
ル-2-チオピリドン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリ
ジン4gに代えて2,3-ジクロロ-5-トリ
フルオロメチルピリジン4.75gを用いる以
外は前記合成例2と同様にして反応を行ない、
後処理を行なって融点125~128℃の目
的物1.9gを得た。

特許出願人 石原産業株式会社

- 8 完 -